

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 7590 de 31 de julio de 2019

Ref. Expediente N° NC2017/0012621

Señor(a)
VIAMET PHARMACEUTICALS (NC), INC.

TÍTULO DE LA SOLICITUD: **“COMPUESTOS DERIVADOS DE BENZONITRILO, COMPOSICIÓN AGRONÓMICA QUE LOS COMPRENDE Y PROCESO PARA SU OBTENCIÓN”**

NÚMERO DE SOLICITUD INTERNACIONAL: PCT/US2016/032877

FECHA DE PRESENTACIÓN INTERNACIONAL: 17 de mayo de 2016.

PRIORIDAD(ES): 18/05/2015, US (ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA), 62/163,106

Como resultado del examen de patentabilidad realizado a la solicitud indicada en la referencia, atendiendo a lo consagrado en el artículo 45 de la Decisión 486 de 2000, se le comunica que esta Dirección ha encontrado que la materia objeto de solicitud no cumple con algunos requisitos establecidos en la Decisión, con fundamento en los siguientes aspectos:

1. Modificaciones presentadas (Art. 34 Decisión 486)

Se aceptan las modificaciones radicadas el 20 de abril de 2018, bajo el número NC2017/0012621, por ajustarse a los requisitos legales.

2. Objeto de la invención

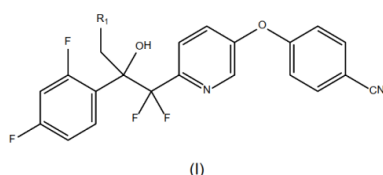
De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del Capítulo Primero del Título X de la Circular Única para efectos del examen de patentabilidad, cuando la solicitud contenga más de diez (10) reivindicaciones y no se haya pagado la tasa complementaria, sólo se estudiarán las cubiertas por la tasa pagada al momento de realizar el examen de patentabilidad consagrado en el artículo 45 de la Decisión 486.

Por lo tanto, se estudiarán las reivindicaciones 1 a 13 del radicado N° NC2017/0012621 del día 20 de abril de 2018.

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de proveer compuestos antifúngicos que demuestren una actividad fungicida mejorada contra hongos relevantes en la agricultura (por ejemplo, una actividad fungicida mejorada contra la mancha de la hoja de trigo causada por *Septoria tritici*) y con propiedades fisicoquímicas favorables (por ejemplo, una buena solubilidad en agua y un valor de coeficiente de partición (Log D) favorable)

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio provee un compuesto de la fórmula (I), una sal aceptable del mismo o una composición agronómica para inhibir la actividad de la metaloenzima *Lanosterol Desmetilasa* (CYP51) en una célula fúngica que reside en o sobre una planta y que comprende la administración eficaz del compuesto definido en la presente.

Adicionalmente, provee un método para sintetizar un compuesto una sal o composición agronómica definido en la presente.

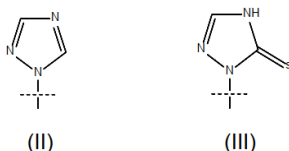


REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 7590 de 31 de julio de 2019

Ref. Expediente N° NC2017/0012621

En donde R₁ es un grupo seleccionado entre una de las Fórmulas (II) o (III) que se muestran a continuación:



3. De la solicitud de patente

3.1. Título

El nombre de la invención de que se trata en el artículo 27 literal d) de la Decisión 486 deberá reflejar el objeto y el campo industrial con el cual se relaciona la misma y ser concordante con la materia descrita y las reivindicaciones de la solicitud. El nombre no podrá referirse a nombres personales, marcas de productos o nombres de fantasía.

De acuerdo con la modificación presentada por el solicitante en el escrito radicado bajo el N° NC2017/0012621 el 20 de abril de 2018 y teniendo en cuenta el objeto de la solicitud, se acepta el título siguiente: “COMPUESTOS DERIVADOS DE BENZONITRILO, COMPOSICIÓN AGRONÓMICA QUE LOS COMPRENDE Y PROCESO PARA SU OBTENCIÓN”.

3.2. Reivindicaciones (Art. 30 Decisión 486)

La reivindicación 4 no es clara porque menciona una reivindicación tipo composición y debe definirse por sus componentes y la proporción de cada uno de ellos.

La reivindicación 4 no es clara porque emplea la expresión: “*uno o más*”; que es imprecisa, por lo cual, no permiten distinguir la invención del estado de la técnica. Se sugiere sustituirla por un término preciso o un rango concreto.

Las reivindicaciones 5 y 10 no son claras porque indica un proceso pero no se mencionan las condiciones en que debieran realizarse las etapas. Se sugiere, entonces, mencionar las condiciones, tales como tiempo, temperatura, concentración de los reactivos, entre otros, ya que un método se define por sus etapas y condiciones necesarias en cada una de ellas.

4. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 18 de mayo de 2015 que corresponde a la fecha de presentación de la solicitud de prioridad.

Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Estado de la técnica

Página 2 de 10

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 7590 de 31 de julio de 2019

Ref. Expediente N° NC2017/0012621

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO2012177635	“Metalloenzyme Inhibitor Compounds”	27-12-2012
D2	WO2010146113	“Antifungal 1,2,4-Triazolyl Derevatives having a 5-Sulfur Substituent”	23-12-2010

D1¹ divulga compuestos de la fórmula 1 inhibidores de metaloenzimas, tratan enfermedades, trastornos o síntomas mediados por tales metaloenzimas y una composición agrícola que comprende el compuesto de la fórmula I. (Resumen página 2 y 14).

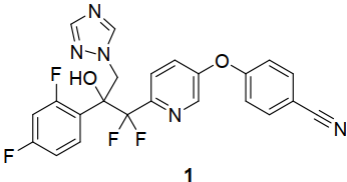
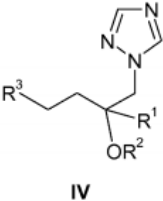
D2² divulga compuestos de triazol nuevos de la fórmula I y II, como se definen a continuación, que llevan un sustituyente de azufre, composiciones agrícolas que los contienen, su uso como fungicidas y compuestos intermedios usados en el método para producirlos. (Párrafo 5: página 1 y 2).

5. Examen de Patentabilidad (Art. 14 Decisión 486)

5.1.Novedad (Art 16 Decisión 486)

La reivindicación 10 consiste en un proceso para sintetizar un compuesto de la fórmula (I) en el cual R₁ es un grupo de la fórmula III...

Tabla 1. Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

Características esenciales	D2
Un proceso para sintetizar... caracterizado porque dicho proceso comprende el contacto de un compuesto de la fórmula 1:	Un proceso para preparar mediante sulfurización un compuesto de triazol con un sustituyente de azufre, que comprende (línea 10 página 51):
 1	Derivado de triazol (línea 10 página 51 y numeral 1.5 línea 9 página 104)  IV
Azufre	Azufre elemental (línea 16 página 51 y numeral 1.5 línea 9 página 104)

1https://worldwide.espacenet.com/searchResults?ST=singleline&locale=en_EP&submitted=true&DB=&query=WO2012177635

2https://worldwide.espacenet.com/searchResults?ST=singleline&locale=en_EP&submitted=true&DB=&query=WO2010146113

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 7590 de 31 de julio de 2019

Ref. Expediente N° NC2017/0012621

Solvente adecuado N-metil-2-pirrolidinona	Solvente adecuado N-metil-2-pirrolidinona (línea 22 página 51 y numeral 1.5 línea 10 página 104)
--	---

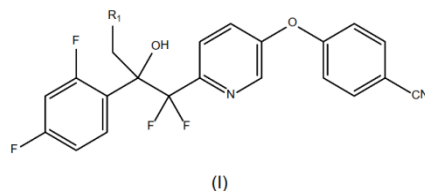
De acuerdo con la tabla anterior, las características esenciales del proceso de la reivindicación 10 no es nuevo porque sus características un compuesto de la fórmula 1, con azufre en la presencia de un solvente adecuado habían sido divulgadas previamente en D2 que menciona un proceso de sulfurización del correspondiente derivado de triazol y que se lleva a cabo adicionando azufre en polvo en N-metilpirrolidinona. (Numeral 1.5 línea 9 y 10 página 104).

Adicionalmente, D2 menciona que el proceso se lleva a cabo a una temperatura de 180°C por 24 horas y bajo presión reducida (numeral 1.5 línea 10, 11 y 13 página 104).

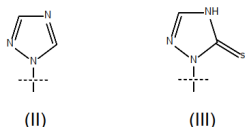
Las reivindicaciones dependientes 11 a 13 tampoco cumplen con el requisito de novedad.

5.2. Nivel Inventivo (Art. 18 Decisión 486)

La **reivindicación 1** consiste en: “Un compuesto caracterizado porque es de la fórmula (I):



En donde R₁ es un grupo seleccionado entre una de las fórmulas (II) o (III) que se muestran a continuación:



o una sal aceptable del mismo” (Radicado N° NC2017/0012621 del 20 de abril de 2018).

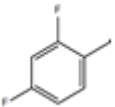
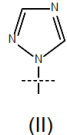
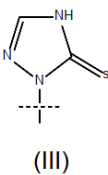
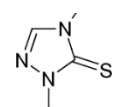
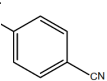
Tabla 1. Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

Características esenciales	D1	D2
Un compuesto caracterizado porque es de la fórmula (I):	Un compuesto caracterizado porque es de la fórmula (I): (Página 2 y 3)	Un compuesto caracterizado porque es de la fórmula (I) y (II): (Página 1).
(I)	(Fórmula I, página 2 y 3) 	Fórmula (I) y (II), página 2 (I) (II)

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 7590 de 31 de julio de 2019

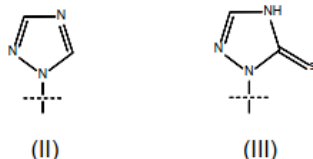
Ref. Expediente N° NC2017/0012621

	R ₄ es arilo sustituido	R1: fenil con 1 a 5 sustituyentes R5, siendo R5 halógeno
-OH	-OR ₇ , siendo R ₇ :H	-OR ² , siendo R ² :H
R1  (II)  (III)	En donde MBG se puede sustituir por un tetrazolilo, triazolilo, oxazolilo, pirimidinilo, tiazolilo o pirazolilo (página 2 y 3). Ejemplo 5, página 58 y 85: Tabla 1, compuesto número 5.	Esquema 1, página 51  
	R ₁ R ₂  , siendo R1 y R2:halogeno	---
O	X: O	
	R5: aril sustituido por R3, R3: CN	

D1 se considera el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga un compuesto de tetrazol (Ejemplo 5, página 58 y 85: Tabla 1, compuesto número 5) que inhibe la actividad de metaloenzimas como la *Lanosterol Desmetilasa* (CYP51) en o sobre una planta que comprende poner en contacto el compuesto con la planta (Página 14 y 16).

D1 también divulga que el compuesto tiene la habilidad de inhibir el crecimiento de una cepa común del patógeno fúngico de la planta *Septoria Tritici* del 50%, al evaluar la concentración inhibitoria mínima y clasificarla en una escala (Página 107, tabla 3: página 108, 109).

La diferencia entre la invención definida en la reivindicación 1 y el compuesto divulgado de D1 consiste en un grupo R1 seleccionado entre una de las fórmulas (II) o (III) que se muestran a continuación:



El efecto que se logra al incluir un grupo R1 seleccionado entre una de las fórmulas (II) o (III) es mejorar la actividad fungicida contra las manchas de las hojas de trigo causado por el hongo *Septoria tritici* y favorecer las propiedades fisicoquímicas de solubilidad en H₂O y el coeficiente de partición (LogD)

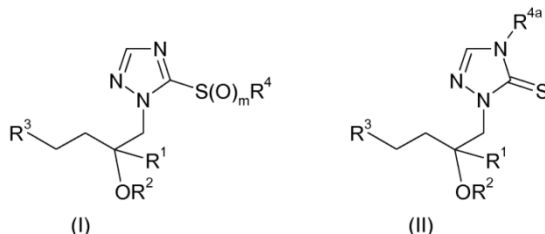
REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 7590 de 31 de julio de 2019

Ref. Expediente N° NC2017/0012621

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿Cómo modificar el compuesto conocido en D1 con el fin de mejorar la actividad fungicida contra las manchas de las hojas de trigo causado por el hongo *Septoria tritici* y favorecer las propiedades fisicoquímicas de solubilidad en H₂O y el coeficiente de partición (LogD)?

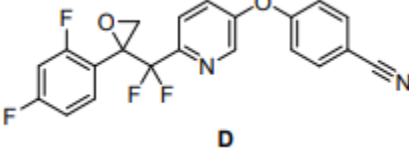
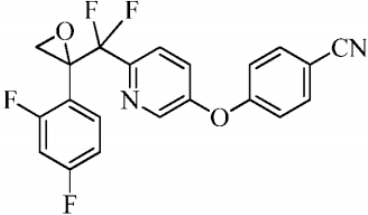
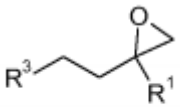
Sin embargo, el incluir un grupo R1 seleccionado entre una de las fórmulas (II) o (III) para mejorar la actividad fungicida contra las manchas de las hojas de trigo causado por el hongo *Septoria tritici* y favorecer las propiedades fisicoquímicas de solubilidad en H₂O y el coeficiente de partición (LogD), ya está divulgado en D2 que se refiere a compuestos de triazol de la fórmula I y II, como se definen a continuación, que llevan un sustituyente de azufre y composiciones agrícolas que los contienen, que controlan enfermedades de las plantas causadas por hongos fitopatógenicos y que tienen una mejor actividad fungicida y compatibilidad (Párrafo 5 y 20 de la página 1 y 2).



En consecuencia, la persona normalmente versada en la materia, estaría motivada a incluir un grupo R1 seleccionado entre una de las fórmulas (II) o (III) de D2 en el compuesto de D1, para así llegar al objeto de la reivindicación 1. Por lo cual se considera obvia.

La **reivindicación 5** consiste en un proceso para sintetizar un compuesto de la fórmula (I) en el cual R₁ es un grupo de la fórmula II...

Tabla 1. Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

Características esenciales	D1	D2
Un proceso para sintetizar... caracterizado porque dicho proceso comprende el contacto de:	Un proceso para sintetizar un compuesto de tetrazol que comprende la reacción (Ejemplo 5, página 58)	Un proceso para preparar un compuesto de triazol que comprende (línea 33, página 51):
Un compuesto de la fórmula D 	Ejemplo 5, página 58 	Compuesto oxirano (línea 33, página 51 y esquema 2 página 52) 
1H-1,2,4-triazol	No se menciona	1H-1,2,4-triazol (línea 33, página 51 y esquema 2 página 52)
Base Carbonato de potasio	Base	Base

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 7590 de 31 de julio de 2019

Ref. Expediente N° NC2017/0012621

	Carbonato de potasio (Ejemplo 5, página 58)	Carbonato de potasio (línea 3 y 4 página 52)
Solvente adecuado Dimetilsulfóxido	No se menciona	N,N-dimetilformamida

D1 se considera el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 5 porque divulga un proceso para sintetizar un compuesto de tetrazol, que comprende la reacción del compuesto F con un tetrazol (1*H*-tetrazol), en presencia de carbonato de potasio y el solvente N,N-dimetilformamida (DMF). (Ejemplo 5, página 58).

La diferencia entre la invención definida en la reivindicación 5 y el proceso divulgado de D1 consiste en el 1*H*-1,2,4-triazol.

No hay efecto asociado al emplear el 1*H*-1,2,4-triazol en la reacción.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿Cómo modificar el proceso conocido en D1 con el fin de obtener un proceso alternativo?

Sin embargo, el incluir el 1*H*-1,2,4-triazol, ya está divulgado en D2 que se refiere a un proceso para preparar un compuesto de triazol a partir de un compuesto oxirano y el 1*H*-1,2,4-triazol en presencia de una base, como hidruros de metales de alcalinos, hidróxidos de metales alcalinos o carbonatos de metales alcalinos (carbonato de potasio), y de un solvente adecuado, como por ejemplo tolueno, N-metilpirrolidinona, éteres (dietil eter, tetrahidrofurano), alcoholes (metanol, etanol, isopropanol o tert-butanol), acetonitrilo o N,N-dimetilformamida (DMF) (línea 33, página 51 y esquema 2 página 52).

Se resalta que es de conocimiento de la persona versada en la materia que el dimetilsulfóxido al igual que la N, N-dimetilformamida son solventes aproticos polares, sin hidrógenos ácidos, así que se comportan de manera similar³.

En consecuencia, la persona normalmente versada en la materia, estaría motivada a incluir el 1*H*-1,2,4-triazol de D2 en el compuesto de D1, para así llegar al objeto de la reivindicación 5. Por lo cual se considera obvia.

Adicionalmente, D1 menciona que el proceso se lleva a cabo a una temperatura de 60°C por 16 horas y en atmósfera inerte (Ejemplo 5, página 58).

Las reivindicaciones dependientes 6 a 9 no mencionan alguna característica que, junto con las características de la reivindicación independiente, aporte nivel inventivo al proceso de la reivindicación 5, por lo cual se considera que no tiene nivel inventivo.

6. Conclusión con respecto a novedad y nivel inventivo

Los requisitos de Patentabilidad de la presente solicitud están afectados así:

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
------	-----------	----------------------------	----------------------

³ Química orgánica avanzada (2013) URL: https://books.google.com.co/books?id=TafEAQAAQBAJ&pg=PA76&dq=solventes+proticos+dimetilsulf%C3%B3xido+y+N,N-dimetilformamida&hl=es&sa=X&ved=0ahUKewiuhbKL-9_jAhUuwikKHRWYCDYQ6AEILjAB#v=onepage&q&f=false

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° **7590** de **31 de julio de 2019**

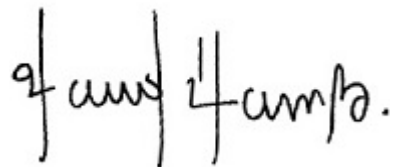
Ref. Expediente N° NC2017/0012621

D1	WO2012177635	1 a 9	Nivel inventivo
D2	WO2010146113	1 a 13	Nivel inventivo
		10 a 13	Novedad

En cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486 de 2000, se le indica que debe dar respuesta dentro del término de sesenta (60) días contados a partir de la fecha de notificación de la presente comunicación. En caso de no dar respuesta al presente requerimiento, o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, se denegará la patente.

Si como respuesta a este requerimiento, el solicitante modifica: i) el capítulo reivindicatorio, ii) la descripción de la invención a proteger, iii) o presenta un nuevo capítulo reivindicatorio deberá observar las instrucciones contenidas en el numeral 1.2.2.1.1., del Capítulo Primero del Título X de la Circular Única y la Dirección de Nuevas Creaciones seguirá el procedimiento descrito en el numeral 1.2.2.5.1.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 6.2 del Capítulo Sexto del Título I de la Circular Única, informándoles que contra el mismo no procede recurso alguno en actuación administrativa.



MARÍA JOSÉ LAMUS BECERRA
DIRECTORA DE NUEVAS CREACIONES

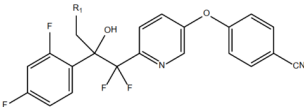
REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 7590 de 31 de julio de 2019

Ref. Expediente N° NC2017/0012621

INFORME DE BÚSQUEDA
EXAMEN DE PATENTABILIDAD

Solicitud No.		Examen de patentabilidad							
NC2017/0012621		1°	X	2°		3°		Revoca	
Solicitud Internacional No.		Fecha solicitud internacional: (DD/MM/AÑO)							
PCT/US2016/032877		17 de mayo de 2016							
Fecha de determinación estado de la técnica (DD/MM/AÑO)				Prioridad			Presentación		
18-05-2015				X					
Solicitante									
VIAMET PHARMACEUTICALS (NC), INC.									
Reivindicaciones que no son objeto de búsqueda por:									
Art. 14	-	Art. 15	-	Art. 20	-	Art. 25 (Falta de unidad de invención)			-

CRITERIOS DE BÚSQUEDA	
Reivindicaciones objeto de búsqueda	1-13
Palabras clave utilizadas	 (I) agronomic composition, benzonitrile, plant, metalloenzyme, antifungal, triazole, sulfur,
Clasificaciones utilizadas para la búsqueda	CIP: C07D 401/06, C07D 403/06, A61K 31/435, A61K 31/4439, A61K 31/4196, A61K 31/41
	CPC:

DOCUMENTOS CONSIDERADOS RELEVANTES (Documentos patente, Literatura no patente (LNP): Artículos, catálogos, etc.)					
Informes de búsqueda / Bases de datos consultadas	N° de solicitud de patente / N° de patente / Autor LNP ⁽¹⁾	Fecha de Publicación /Presentación (DD/MM/AAAA)	Reivindicaciones /Secuencias afectadas	Citas relevantes del estado de la técnica	Categoría del documento citado ⁽²⁾
ISA	WO2012177635	27-12-2012	1-13	Resumen página 2 y 14 Fórmula I, página 2 y 3 Grupo MBG: Página 2 y 3 Ejemplo 5, página 58 y 85: Tabla 1, compuesto número 5. Página 14 y 16 Página 107, tabla 3: página 108, 109	Y
Orbit	WO2010146113	23-12-2010	1-13	Párrafo 5: página 1 y 2 Fórmula (I) y (II), página 2 Esquema 1, página 51 Párrafo 5 y 20 de la página 1 y 2 Esquema 1, párrafo 10: página 51 y numeral 1.5 párrafo 10: página 104	X, Y
Patbase	WO2014193974	04-12-2014	-	-	A
⁽¹⁾ Cita completa literatura no patente (LNP)					

REPÚBLICA DE COLOMBIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 7590 de 31 de julio de 2019

Ref. Expediente N° NC2017/0012621

Apellido, A. A. (Fecha). Título del artículo. <i>Nombre de la revista. Volumen</i> (Número), pp-pp.	
O	
Apellido, A. A. (Fecha). Título del artículo. Nombre de la revista. Recuperado de http://xxxxxxx .	
(2) Categorías de documentos citados	
“A” Documento que define el estado general de la técnica no considerado como particularmente relevante. “E” Solicitud de patente o patente anterior pero publicada en la fecha de presentación internacional o en fecha posterior. “L” Documento citado para llamar la atención sobre por ejemplo, dudas acerca de una reivindicación de prioridad o para determinar la fecha de publicación de otra cita, siempre van acompañados de una explicación, por la cual se citan. “O” Documento del tipo actas de conferencia, este tipo de documentos siempre estará acompañado por otra letra que indique la pertinencia del documento, por ejemplo, O,X, O,Y o bien O,A. “P” Documento publicado antes de la fecha de presentación internacional pero con posterioridad a la fecha de prioridad reivindicada.	“T” Documento publicado en fecha posterior a la de presentación o la de prioridad de la solicitud internacional y no entra en conflicto con dicha solicitud, pero puede ser útil para la mejor comprensión del principio o teoría en que se basa la invención, o para demostrar que el razonamiento o los hechos en los que se basa dicha invención son incorrectos. “X” Documento particularmente relevante; la invención reivindicada no puede considerarse nueva o que implique una actividad inventiva por referencia al documento aisladamente considerado. “Y” Documento particularmente relevante; la invención reivindicada no puede considerarse que implique una actividad inventiva cuando el documento se asocia a otro u otros documentos de la misma naturaleza, cuya combinación resulta evidente para un experto en la materia.
Fecha del reporte de búsqueda: (23/07/2019)	
Examinador: Lilí Sofía Victoria Pitta Gaona	